

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2002 年 11 月 7 日 (07.11.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/088075 A1

(51) 国際特許分類: C07C 323/42, 317/28, 317/40,
C07D 213/64, A01N 37/22, 41/10, 43/40

(FUJIOKA,Shinsuke) [JP/JP]; 〒586-0037 大阪府 河内
長野市 上原町474-1-103 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/04172

(74) 代理人: 浅村 皓, 外 (ASAMURA,Kiyoshi et al.); 〒
100-0004 東京都 千代田区 大手町 2 丁目 2 番 1 号 新
大手町ビル 3 3 1 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2002 年 4 月 25 日 (25.04.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU,
LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM,
PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN,
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2001-130404 2001 年 4 月 26 日 (26.04.2001) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本農薬
株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒
103-8236 東京都 中央区 日本橋 1 丁目 2 番 5 号 Tokyo
(JP).

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特
許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 原山 博人
(HARAYAMA,Hiroto) [JP/JP]; 〒586-0022 大阪府
河内長野市 本多町 5-6-305 Osaka (JP). 遠西 正範
(TOHNISHI,Masanori) [JP/JP]; 〒599-8241 大阪府
堺市 福田 1040-1-408 Osaka (JP). 森本 雅之 (MO-
RIMOTO,Masayuki) [JP/JP]; 〒586-0024 大阪府 河
内長野市 西之山町 1-28-305 Osaka (JP). 藤岡 伸祐

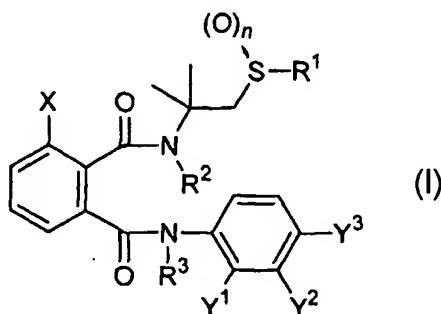
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PHTHALAMIDE DERIVATIVES, INSECTICIDES FOR AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL USE AND
METHOD FOR APPLICATION THEREOF

(54) 発明の名称: フタルアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法



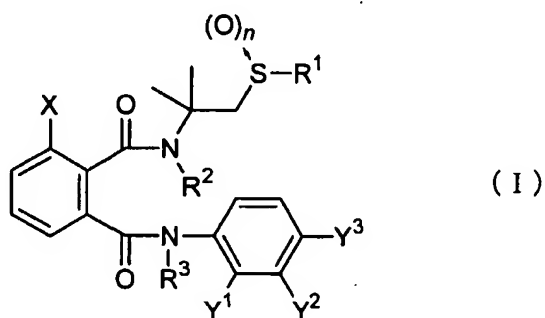
(57) Abstract: Phthalamide derivatives represented by the general formula (I); insecticides for agricultural and horticultural use, containing the derivatives as the active ingredient; and a method for application thereof: (I) wherein R¹, R² and R³ are each independently hydrogen, C₁₋₆ alkyl, C₃₋₆ alkenyl, or C₃₋₆ alkynyl; X and Y³ are each independently halogeno; Y¹ and Y² are each independently hydrogen, halogeno, nitro, cyano, C₁₋₆ alkyl, or the like; and n is an integer of 0 to 2.

[続葉有]



(57) 要約:

本発明は、一般式 (I)



(式中、R¹、R²及びR³は同一又は異なっても良く、水素原子、C₁-C₆アルキル基、C₃-C₆アルケニル基又はC₃-C₆アルキニル基を示し、X及びY³は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子を示し、Y¹及びY²は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C₁-C₆アルキル基等を示し、nは0から2の整数を示す。)で表されるフタルアミド誘導体及び当該化合物を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関する。

明 細 書

フタルアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

5 技術分野

本発明はフタルアミド誘導体及び該化合物を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

背景技術

- 特開平 1 1 - 2 4 0 8 5 7 号公報及び特開 2 0 0 1 - 1 3 1 1 4 1 号公報には、
- 10 本発明のフタルアミド誘導体と類似した化合物が農園芸用殺虫剤として有用であることが記載されている。しかしながら、これらの公報には、本発明化合物についての実施例、物性等は記載されていない。

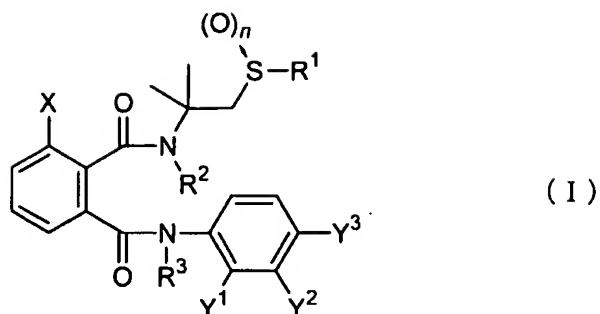
- 農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用薬剤、特に農園芸用殺
- 15 虫剤の開発が望まれている。又、就農者の高齢化等により各種の省力的施用方法が求められるとともに、これらの施用方法に適した性格を有する農園芸用薬剤の創出が求められている。

発明の開示

- 本発明者等は新規な農園芸用薬剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明
- 20 の一般式 (I) で表されるフタルアミド誘導体が文献未記載の新規化合物であり、特開平 1 1 - 2 4 0 8 5 7 号公報及び特開 2 0 0 1 - 1 3 1 1 4 1 号公報に記載の化合物に対し、低薬量で優れた殺虫効果を示し、特に土壌等に処理することにより、根からの高い吸収移行作用を示す優れた農園芸用殺虫剤であることを見だし、本発明を完成させたものである。

- 25 即ち、本発明は一般式 (I)

5



(式中、 R^1 、 R^2 及び R^3 は同一又は異なっても良く、水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_3-C_6 アルケニル基又は C_3-C_6 アルキニル基を示し、 X 及び Y^3 は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子を示し、 Y^1 及び Y^2 は同一又は
 10 異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_2-C_6 アルケニル基、ハロ C_2-C_6 アルケニル基、 C_2-C_6 アルキニル基、ハロ C_2-C_6 アルキニル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチ
 15 オ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基を示し、 n は0～2の整数を示す。)

で表されるフタルアミド誘導体及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用
 20 殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

本発明の化合物は低薬量で優れた殺虫効果を示し、特に土壌等に処理することにより、根からの高い吸収移行作用を示す。

発明を実施するための形態

本発明のフタルアミド誘導体の一般式 (I) の定義において、「ハロゲン原
 25 子」とは塩素原子、臭素原子、碘素原子又はフッ素原子を示し、「 C_1-C_6 アルキル」とは、例えばメチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピル、 n -ブチル、 i -ブチル、 s -ブチル、 t -ブチル、 n -ペンチル、 n -ヘキシル等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「ハロ C_1-C_6 アルキル」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された

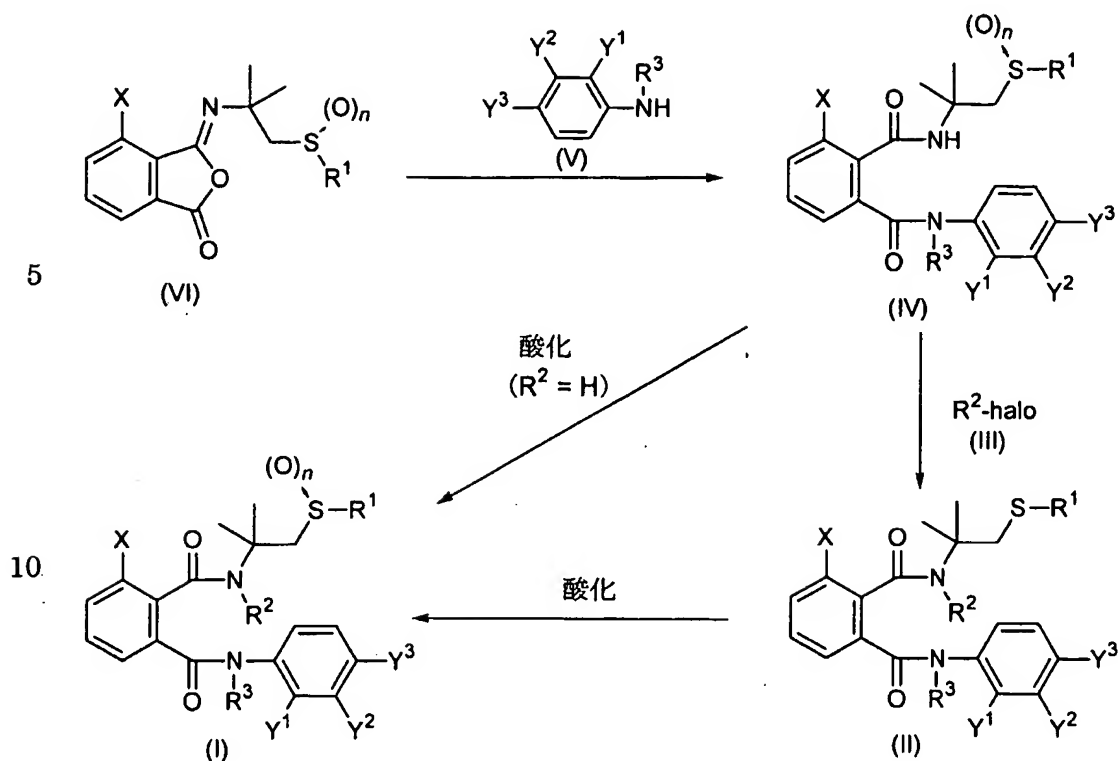
直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数 1～6 個のアルキル基を示し、「C₃-C₆ シクロアルキル」とは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等に炭素原子 3～6 の環状アルキル基等を示す。

本発明の一般式 (I) で表されるフタルアミド誘導体は、その構造式中に 1 つ
5 又は複数個の不斉中心を含む場合があり、2 種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあるが、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式 (I) で表されるフタルアミド誘導体は、その構造式中に炭素-炭素二重結合に由来する 2 種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそ
10 れらが任意の割合で含まれる混合物をも包含するものである。

本発明の一般式 (I) で表されるフタルアミド誘導体のうち、好ましい化合物として、R¹ が C₁-C₆ アルキル基を示し、R² 及び R³ が水素原子を示し、X 及び Y³ が同一又は異なっても良く、ハロゲン原子を示し、Y¹ がハロゲン原子又は C₁-C₆ アルキル基を示し、Y² がハロゲン原子を示し、n が 0～2 の整数
15 を示すフタルアミド誘導体が挙げられ、更に好ましい化合物として、R¹ がメチル基を示し、R² 及び R³ が水素原子を示し、X がヨウ素原子を示し、Y¹、Y²、Y³ が同一又は異なっても良く、ハロゲン原子を示し、n が 0～2 の整数を示すフタルアミド誘導体が挙げられる。

以下に本発明の代表的な製造方法を図式的に示すが、本発明はこれらに限定さ
20 れるものではない。

4



- 15 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 Y^1 、 Y^2 、 Y^3 は前記に同じくし、haloはハロゲン原子を示す。)

一般式 (VI) で表されるフタルイソイミド誘導体と一般式 (V) で表されるアニリン誘導体とを酸又は塩基の存在下若しくは非存在下に、不活性溶媒中で反応させることにより、一般式 (IV) で表されるフタルアミド誘導体とし、該フタルアミド誘導体 (IV) を脱ハロゲン化水素剤及び不活性溶媒の存在下に一般式 (III) で表されるハライド類と反応させることにより、一般式 (II) で表されるフタルアミド誘導体とし、該フタルアミド誘導体 (II) を不活性溶媒の存在下に酸化剤と反応させることにより、一般式 (I) で表されるフタルアミド誘導体を製造することができる。

- 25 R^2 が水素原子の場合は、一般式 (II) で表されるフタルアミド誘導体を経由することなく、一般式 (IV) で表されるフタルアミド誘導体を不活性溶媒の存在下に酸化剤と反応させることにより、一般式 (I) で表されるフタルアミド誘導体を製造することができる

本発明の原料化合物である一般式 (VI) で表されるフタルイソイミド誘導体は

特開平11-240857号公報及び特開2001-131141号公報に記載の製造方法に従って製造することができる。

(1) . 一般式 (VI) → 一般式 (IV)

本反応は J. Med. Chem. , 10, 982 (1967) に記載の方法に
5 従って目的物を製造することができる。

本反応で使用する不活性溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、メチル t-ブチルエーテル、ジオキサン、クロロホルム、塩化メチレン、クロロベンゼン、トルエン、アセトニトリル、酢酸エチル、酢酸ブチル等を例示することができる。

- 10 本反応で使用する酸としては、例えば酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、塩酸、硫酸等の無機酸類を例示することができ、その使用量は、一般式 (VI) で表されるフタルイソイミド誘導体に対して触媒量乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は、一般式 (VI) で表
15 されるフタルイソイミド誘導体に対して触媒量乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

反応温度は 0℃ 乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至 48 時間の範囲である。

- 20 反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

(2) . 一般式 (IV) → 一般式 (II)

- 本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、フルオロベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド
25

等のアミド類、酢酸等の酸類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

脱ハロゲン化水素剤としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウム等の無機塩基類を例示することができる。本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適宜選択すれば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

(3). 一般式(II)又は(IV)→一般式(I)

本反応で使用する不活性溶媒としては、例えば塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、フルオロベンゼン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、酢酸等の酸類、メタノール、エタノール、プロパノール等のアルコール類を例示することができる。

酸化剤としては、例えばメタクロロ過安息香酸、過酢酸、メタ過ヨウ素酸カリウム、過硫酸水素カリウム(オキシソル)、過酸化水素等を例示することができ、その使用量は一般式(II)又は(IV)で表されるフタルアミド誘導体に対して0.5~3当量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。

反応温度は-50℃~使用する不活性溶媒の沸点域の範囲で行えば良く、反応時間は反応温度、反応規模等により一定しないが、数分乃至24時間の範囲である。

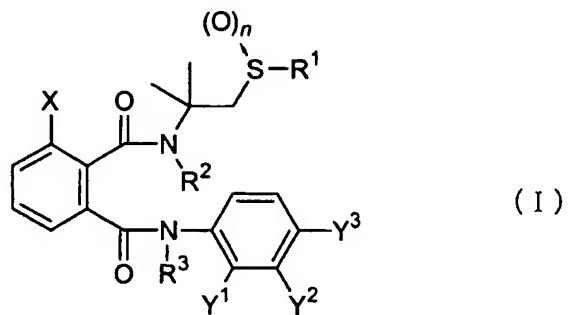
反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応

じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

以下に本発明の一般式（I）で表されるフタルアミド誘導体の代表的な化合物を第1表及び2表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

5 一般式（I）

10



第1表 ($R^1 = CH_3$ 、 $R^2 = H$)

No.	R^3	X	γ^1	γ^2	γ^3	n	融点 (°C)
1	H	F	Cl	Cl	Cl	0	199-201
2	H	Cl	Cl	Cl	Cl	0	189-190
3	H	Cl	Cl	Cl	Cl	1	
4	H	Cl	Cl	Cl	Cl	2	198-201
5	H	Br	Cl	Cl	Cl	0	178-181
6	H	Br	Cl	Cl	Cl	1	
7	H	Br	Cl	Cl	Cl	2	227-228
8	H	I	H	Cl	F	0	
9	H	I	H	Cl	Cl	0	
10	H	I	H	Cl	Br	0	
11	H	I	H	Cl	I	0	
12	H	I	H	Br	Cl	0	209-211
13	H	I	H	Br	Br	0	
14	H	I	H	Br	I	0	
15	H	I	H	I	Cl	0	204-206
16	H	I	H	I	Br	0	
17	H	I	H	I	I	0	
18	H	I	H	CF ₃	F	0	
19	H	I	H	CF ₃	Cl	0	180-182
20	H	I	H	CF ₃	Cl	1	129-134
21	H	I	H	CF ₃	Cl	2	
22	H	I	H	CF ₃	Br	0	
23	H	I	H	CF ₃	I	0	88-90
24	H	I	CH ₃	H	Cl	0	178-180

第1表 (続き)

No.	R ³	X	Y ¹	Y ²	Y ³	n	融点 (°C)
25	H	I	CH ₃	H	Cl	1	112-113
26	H	I	CH ₃	H	Cl	2	106-107
27	H	I	CH ₃	H	Br	0	172-173
28	H	I	CH ₃	H	Br	1	96-98
29	H	I	CH ₃	H	Br	2	118-120
30	H	I	CH ₃	H	I	0	155-157
31	H	I	CH ₃	H	I	1	99-102
32	H	I	CH ₃	H	I	2	116-118
33	H	I	CH ₃	F	F	0	
34	H	I	CH ₃	F	Cl	0	
35	H	I	CH ₃	F	Br	0	
36	H	I	CH ₃	F	I	0	
37	H	I	CH ₃	Cl	F	0	
38	H	I	CH ₃	Cl	Cl	0	
39	H	I	CH ₃	Cl	Cl	1	
40	H	I	CH ₃	Cl	Cl	2	
41	H	I	CH ₃	Cl	Br	0	
42	H	I	CH ₃	Cl	I	0	202-204
43	H	I	CH ₃	Cl	I	1	102-107
44	H	I	CH ₃	Cl	I	2	132-135
45	H	I	CH ₃	Br	Cl	0	
46	H	I	CH ₃	Br	Br	0	
47	H	I	CH ₃	Br	I	0	
48	H	I	CH ₃	I	Cl	0	

第1表 (続き)

No.	R ³	X	Y ¹	Y ²	Y ³	n	融点 (°C)
49	H	I	CH ₃	I	Br	0	
50	H	I	CH ₃	I	I	0	
51	H	I	CH ₃	CF ₃	Cl	0	
52	H	I	CH ₃	CF ₃	Br	0	
53	H	I	CH ₃	CF ₃	I	0	
54	H	I	CF ₃	H	Cl	0	
55	H	I	CF ₃	H	Br	0	
56	H	I	CF ₃	H	I	0	154-155
57	H	I	CF ₃	H	I	1	120-125
58	H	I	CF ₃	H	I	2	115-117
59	H	I	CF ₃	Cl	Cl	0	
60	H	I	CF ₃	Cl	Cl	1	
61	H	I	CF ₃	Cl	Cl	2	
62	H	I	CF ₃	Cl	Br	0	
63	H	I	CF ₃	Cl	I	0	
64	H	I	CN	H	Cl	0	144-148
65	H	I	CN	H	Cl	1	118-121
66	H	I	CN	H	Cl	2	114-117
67	H	I	CN	H	Br	0	
68	H	I	CN	H	I	0	
69	H	I	CN	Cl	Cl	0	
70	H	I	CN	Cl	Cl	1	
71	H	I	CN	Cl	Cl	2	
72	H	I	CN	Cl	Br	0	

第1表 (続き)

No.	R ³	X	Y ¹	Y ²	Y ³	n	融点 (°C)
73	H	I	CN	Cl	I	0	
74	H	I	F	H	F	0	146-148
75	H	I	F	H	F	1	85-88
76	H	I	F	H	F	2	
77	H	I	F	H	Cl	0	
78	H	I	F	H	Br	0	
79	H	I	F	H	I	0	
80	H	I	F	F	F	0	157-159
81	H	I	F	F	Cl	0	
82	H	I	F	F	Br	0	
83	H	I	F	F	I	0	
84	H	I	F	Cl	F	0	169-171
85	H	I	F	Cl	Cl	0	
86	H	I	F	Cl	Cl	1	
87	H	I	F	Cl	Cl	2	
88	H	I	F	Cl	Br	0	
89	H	I	F	Cl	I	0	
90	H	I	F	Br	F	0	
91	H	I	F	Br	Cl	0	
92	H	I	F	Br	Br	0	
93	H	I	F	Br	I	0	
94	H	I	F	I	F	0	
95	H	I	F	I	Cl	0	
96	H	I	F	I	Br	0	

第1表 (続き)

No.	R ³	X	Y ¹	Y ²	Y ³	n	融点 (°C)
97	H	I	F	I	I	0	
98	H	I	Cl	H	F	0	
99	H	I	Cl	H	Cl	0	155-157
100	H	I	Cl	H	Cl	1	82-86
101	H	I	Cl	H	Cl	2	109-111
102	H	I	Cl	H	Br	0	149-151
103	H	I	Cl	H	Br	1	85-89
104	H	I	Cl	H	Br	2	118-120
105	H	I	Cl	H	I	0	133-135
106	H	I	Cl	H	I	1	84-88
107	H	I	Cl	H	I	2	108-109
108	H	I	Cl	F	F	0	
109	H	I	Cl	F	Cl	0	
110	H	I	Cl	F	Cl	1	
111	H	I	Cl	F	Cl	2	
112	H	I	Cl	F	Br	0	
113	H	I	Cl	F	I	0	
114	H	I	Cl	Cl	F	0	
115	H	I	Cl	Cl	F	1	
116	H	I	Cl	Cl	F	2	
117	H	I	Cl	Cl	Cl	0	175-176
118	H	I	Cl	Cl	Cl	1	94-98
119	H	I	Cl	Cl	Cl	2	239-241
120	H	I	Cl	Cl	Br	0	183

第1表 (続き)

No.	R ³	X	Y ¹	Y ²	Y ³	n	融点 (°C)
121	H	I	Cl	Cl	Br	1	95-100
122	H	I	Cl	Cl	Br	2	243
123	H	I	Cl	Cl	I	0	183-185
124	H	I	Cl	Cl	I	1	89-94
125	H	I	Cl	Cl	I	2	111-113
126	H	I	Cl	Br	F	0	
127	H	I	Cl	Br	Cl	0	
128	H	I	Cl	Br	Cl	1	
129	H	I	Cl	Br	Cl	2	
130	H	I	Cl	Br	Br	0	
131	H	I	Cl	Br	I	0	
132	H	I	Cl	I	Cl	0	
133	H	I	Cl	I	Cl	1	
134	H	I	Cl	I	Cl	2	
135	H	I	Cl	I	Br	0	
136	H	I	Cl	I	I	0	
137	H	I	Cl	CH ₃	F	0	
138	H	I	Cl	CH ₃	Cl	0	169-173
139	H	I	Cl	CH ₃	Br	0	
140	H	I	Cl	CH ₃	I	0	
141	H	I	Cl	CF ₃	F	0	
142	H	I	Cl	CF ₃	Cl	0	196-198
143	H	I	Cl	CF ₃	Cl	1	97-101
144	H	I	Cl	CF ₃	Cl	2	205-207

第1表 (続き)

No.	R ³	X	Y ¹	Y ²	Y ³	n	融点 (°C)
145	H	I	Cl	CF ₃	Br	0	
146	H	I	Cl	CF ₃	I	0	
147	H	I	Cl	CN	Cl	0	184-185
148	H	I	Cl	CN	Cl	1	92-97
149	H	I	Cl	CN	Cl	2	206-208
150	H	I	Cl	CN	Br	0	
151	H	I	Cl	CN	I	0	
152	H	I	Cl	OCHF ₂	Cl	0	
153	H	I	Cl	OCClF ₂	Cl	0	96-98
154	H	I	Cl	OCF ₃	Cl	0	
155	H	I	Cl	SCF ₃	Cl	0	
156	H	I	Cl	NO ₂	Cl	0	
157	H	I	Br	H	F	0	
158	H	I	Br	H	Cl	0	
159	H	I	Br	H	Br	0	
160	H	I	Br	H	I	0	
161	H	I	Br	F	Cl	0	
162	H	I	Br	F	Br	0	
163	H	I	Br	F	I	0	
164	H	I	Br	Cl	Cl	0	
165	H	I	Br	Cl	Cl	1	
166	H	I	Br	Cl	Cl	2	
167	H	I	Br	Cl	Br	0	
168	H	I	Br	Cl	I	0	

第1表 (続き)

No.	R ³	X	Y ¹	Y ²	Y ³	n	融点 (°C)
169	H	I	Br	Br	Cl	0	
170	H	I	Br	Br	Br	0	
171	H	I	Br	Br	I	0	
172	H	I	Br	I	Cl	0	
173	H	I	Br	I	Br	0	
174	H	I	Br	I	I	0	
175	H	I	I	H	F	0	160-163
176	H	I	I	H	Cl	0	
177	H	I	I	H	Br	0	
178	H	I	I	H	I	0	
179	H	I	I	F	Cl	0	
180	H	I	I	F	Br	0	
181	H	I	I	F	I	0	
182	H	I	I	Cl	Cl	0	
183	H	I	I	Cl	Cl	1	
184	H	I	I	Cl	Cl	2	
185	H	I	I	Cl	Br	0	
186	H	I	I	Cl	I	0	
187	H	I	I	Br	Cl	0	
188	H	I	I	Br	Br	0	
189	H	I	I	Br	I	0	
190	H	I	I	I	Cl	0	
191	H	I	I	I	Br	0	
192	H	I	I	I	I	0	

第1表 (続き)

No.	R ³	X	Y ¹	Y ²	Y ³	n	融点 (°C)
193	H	I	OCH ₃	H	Cl	0	
194	H	I	OCH ₃	H	Br	0	
195	H	I	OCH ₃	H	I	0	
196	H	I	OCH ₃	Cl	Cl	0	107-109
197	H	I	OCH ₃	Cl	Br	0	
198	H	I	OCH ₃	Cl	I	0	
199	H	I	OCF ₃	H	Cl	0	
200	H	I	OCF ₃	H	Br	0	
201	H	I	OCF ₃	H	I	0	145-147
202	H	I	OCF ₃	H	I	1	98-102
203	H	I	OCF ₃	H	I	2	
204	H	I	OCF ₃	Cl	Cl	0	
205	H	I	OCF ₃	Cl	Br	0	
206	H	I	OCF ₃	Cl	I	0	
207	H	I	SCH ₃	H	Cl	0	
208	H	I	SCH ₃	H	Br	0	
209	H	I	SCH ₃	H	I	0	
210	H	I	SCH ₃	Cl	Cl	0	
211	H	I	SCH ₃	Cl	Br	0	
212	H	I	SCH ₃	Cl	I	0	
213	H	I	SCHF ₂	H	I	0	76-79
214	H	I	SCHF ₂	H	I	1	
215	H	I	SCHF ₂	H	I	2	
216	H	I	N(CH ₃) ₂	H	I	0	51-56

第1表 (続き)

No.	R ³	X	Y ¹	Y ²	Y ³	n	融点 (°C)
217	H	I	N(CH ₃) ₂	H	I	1	73-77
218	H	I	N(CH ₃) ₂	H	I	2	
219	CH ₃	I	Cl	Cl	Cl	0	159-161
220	CH ₃	I	Cl	Cl	Cl	1	
221	CH ₃	I	Cl	Cl	Cl	2	
222	H	I	F	CH ₃	Cl	0	100-102
223	H	I	F	CH ₃	Cl	1	198
224	H	I	F	CH ₃	Cl	2	228-231
225	H	I	CH ₃	CH ₃	F	0	190
226	H	I	CH ₃	CH ₃	F	1	97-99
227	H	I	CH ₃	CH ₃	F	2	209
228	H	I	OCH ₃	Cl	Cl	1	88
229	H	I	OCH ₃	Cl	Cl	2	83
230	H	I	H	CHF ₂	Cl	0	180
231	H	I	H	CHF ₂	Cl	1	163-166
232	H	I	H	CHF ₂	Cl	2	225
233	H	I	I	H	F	1	201
234	H	I	I	H	F	2	137
235	H	I	SCH ₃	Cl	Cl	0	146-147

第2表 ($R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$)

No.	R^3	X	Y^1	Y^2	Y^3	n	融点 (°C)
236	H	Cl	Cl	Cl	Cl	0	
237	H	I	Cl	Cl	Cl	0	
238	H	I	Cl	Cl	Cl	1	
239	H	I	Cl	Cl	Cl	2	
240	CH_3	I	Cl	Cl	Cl	0	
241	CH_3	I	Cl	Cl	Cl	1	
242	CH_3	I	Cl	Cl	Cl	2	
243	H	I	H	Cl	F	0	
244	H	I	H	Cl	Cl	0	
245	H	I	H	Cl	Br	0	
246	H	I	H	Cl	I	0	

以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

- 5 実施例1. $N^2 - (1, 1 - ジメチル - 2 - メチルチオエチル) - 3 - ヨード - N^1 - (4 - ヨード - 2 - メチルフェニル) フタルアミド$ (化合物No. 30) の製造

$N - (1, 1 - ジメチル - 2 - メチルチオエチル) - 3 - ヨードフタルイソイミド$ 1.5 g (4ミリモル) をアセトニトリル10mlに溶解し、該溶液に4-
 10 ヨード-2-メチルアニリン0.89 g (3.8ミリモル) を加える。10分後、析出した結晶を濾集することにより目的物1.94 gを得た。

物性: m. p. 155~157°C 収率: 84%

- 実施例2. $N^2 - (1, 1 - ジメチル - 2 - メチルスルフィニルエチル) - 3 - ヨード - N^1 - (4 - ヨード - 2 - メチルフェニル) フタルアミド$ (化合物No. 31) の製造
 15

$N^2 - (1, 1 - ジメチル - 2 - メチルチオエチル) - 3 - ヨード - N^1 - (4 - ヨード - 2 - メチルフェニル) フタルアミド$ 0.5 g (0.82ミリモ

- ル) をクロロホルム 10 ml に溶解して 0℃ に冷却し、該溶液にメタクロロ過安息香酸 0.19 g (1.1 ミリモル) を加える。1 時間室温で攪拌後、反応液を水中に注ぎ、目的物をクロロホルムで抽出した。有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液及び 10% 炭酸カリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、
- 5 減圧下に溶媒を留去した。残渣を少量のエーテルで洗浄することにより目的物 0.35 g を得た。

物性 : m. p. 99 ~ 102℃ 収率 : 71%

- 製造例 3. $N^2 - (1, 1\text{-ジメチル-2-メチルスルホニルエチル}) - 3\text{-ヨード-}N^1 - (4\text{-ヨード-2-メチルフェニル})$ フタルアミド (化合物 No. 10 32) の製造

- $N^2 - (1, 1\text{-ジメチル-2-メチルチオエチル}) - 3\text{-ヨード-}N^1 - (4\text{-ヨード-2-メチルフェニル})$ フタルアミド 0.5 g (0.82 ミリモル) をクロロホルム 10 ml に溶解し、該溶液にメタクロロ過安息香酸 0.47 g (2.72 ミリモル) を加える。3 時間室温で攪拌後、反応液を水中に注ぎ、
- 15 目的物をクロロホルムで抽出した。有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液及び 10% 炭酸カリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。残渣を少量のエーテルで洗浄することにより目的物 0.37 g を得た。

物性 : m. p. 116 ~ 118℃ 収率 : 74%

- 20 本発明の一般式 (I) で表されるフタルアミド誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.)、リンゴコシンクイ (*Grapholita inopinata*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、クワハマキ (*Olethreutes mori*)、チャノホソガ (*Caloptilia thevivor*)、リンゴホソガ (*Caloptilia zachrysa*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*)、ナシホソガ (*Spulerrina astaurota*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、オオタバコガ類 (*Heliothis* sp.)、コドリंगा (*Laspeyresia pomonella*)、コナ
- 25

- ガ(*Plutella xylostella*)、リンゴヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、モ
モシンクイガ(*Carposina niponensis*)、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*)、コブ
ノメイガ(*Cnaphalocrocis medinalis*)、チャマダラメイガ(*Ephestia elutella*)、
クワノメイガ(*Glyphodes pyloalis*)、サンカメイガ(*Scirpophaga incertulas*)、
5 イチモンジセセリ(*Parnara guttata*)、アワヨトウ(*Pseudaletia separata*)、イ
ネヨトウ(*Sesamia inferens*)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、シロイチ
モジヨトウ(*Spodoptera egigua*)等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ
(*Macrosteles fascifrons*)、ツマグロヨコバイ(*Nephotettix cincticeps*)、トビ
イロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)、ミカ
10 ンキジラミ(*Diaphorina citri*)、ブドウコナジラミ(*Aleurolobus taonabae*)、タ
バココナジラミ(*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes*
vaporariorum)、ニセダイコンアブラムシ(*Lipaphis erysimi*)、モモアカアブラ
ムシ(*Myzus persicae*)、ツノロウムシ(*Ceroplastes ceriferus*)、ミカンワタカ
イガラムシ(*Pulvinaria aurantii*)、ミカンマルカイガラムシ(*Pseudaonidia*
15 *duplex*)、ナシマルカイガラムシ(*Comstockaspis perniciosus*)、ヤノネカイガラ
ムシ(*Unaspis yanonensis*)等の半翅目害虫、ネグサレセンチュウ(*Pratylenchus*
sp.)、ヒメコガネ(*Anomala rufocuprea*)、マメコガネ(*Popilla japonica*)、タバ
コシバンムシ(*Lasioderma serricorne*)、ヒラタキクイムシ(*Lyctus brunneus*)、
ニジュウヤホシテントウ(*Epilachna vigintiotopunctata*)、アズキノウムシ
20 (*Callosobruchus chinensis*)、ヤサイゾウムシ(*Listroderes costirostris*)、コ
クゾウムシ(*Sitophilus zeamais*)、ワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis grandis*)、
イネミズゾウムシ(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、ウリハムシ(*Aulacophora*
femoralis)、イネドロオイムシ(*Oulema oryzae*)、キスジノミハムシ
(*Phyllotreta striolata*)、マツノキクイムシ(*Tomicus piniperda*)、コロラドポ
25 テトビートル(*Leptinotarsa decemlineata*)、メキシカンビーンビートル
(*Epilachna varivestis*)、コーンルートワーム類(*Diabrotica sp.*)等の甲虫目害
虫、ウリミバエ(*Dacus*(*Zeugodacus*)*cucurbitae*)、ミカンコミバエ
(*Dacus*(*Bactrocera*)*dorsalis*)、イネハモグリバエ(*Agromyza oryzae*)、タマネギ
バエ(*Delia antiqua*)、タネバエ(*Dalia platura*)、ダイズサヤタマバエ

(*Asphondylia* sp.)、イエバエ(*Musca domestica*)、アカイエカ(*Culex pipiens pipiens*)等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ(*Pratylenchus coffeae*)、ジャガイモシストセンチュウ(*Glabodera rostchiensis*)、ネコブセンチュウ(*Meloidogyne* sp.)、ミカンネセンチュウ(*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネ
5 グサレセンチュウ(*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ(*Aphelenchoides ritzemabosi*)等のハリセンチュウ目害虫等に対して強い殺虫効果を有するものである。

本発明の一般式(I)で表されるフタルアミド誘導体を有効成分とする農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を
10 与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用殺虫剤は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に
15 製剤して使用するのが一般的である。

即ち、一般式(I)で表されるフタルアミド誘導体はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。
20 本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等)、タルク類(例えばタルク、ピロフィライト等)、シリカ類(例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイต์カーボン(含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。))、
25 活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫安、燐安、硝安、尿素、

塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうることもなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類（例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等）、エーテル類（例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等）、脂肪族炭化水素類（例えばケロシン、鉱油等）、芳香族炭化水素類（例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等）、エステル類（例えば酢酸エチル、ジイソプロピルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等）、アミド類（例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等）、ニトリル類（例えばアセトニトリル等）、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び／又は湿潤の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び／又は結合の目的のために、次に

例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

- 5 固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

- 10 防腐剤としては、1, 2-ベンズイソチアゾリン-3-オン、パラクロロメタキシレノール、パラオキシ安息香酸ブチル等も添加することが出来る。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の添加剤も加えることが可能である。

- 15 有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、農園芸用殺虫剤100重量部中、0.01～90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば粉剤又は粒剤とする場合は0.01～50重量%、又乳剤又は水和剤とする場合も同様0.01～50重量%が適当である。

- 本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適
20 宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

- 本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001
25 g～10kg、好ましくは0.01g～1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用殺虫剤は、更に防除対象病虫害、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又、使用場面に応じて除

草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

- かかる目的で使用する他の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤としては、例えばエチオン、トリクロルホン、メタミドホス、アセフェート、ジクロルボス、メ
ビンホス、モノクロトホス、マラチオン、ジメトエート、ホルモチオン、メカル
5 バム、バミドチオン、チオメトン、ジスルホトン、オキシデプロホス、ナレッド、
メチルパラチオン、フェニトロチオン、シアノホス、プロパホス、フェンチオン、
プロチオホス、プロフェノホス、イソフェンホス、テメホス、フェントエート、
ジメチルビンホス、クロルフェビンホス、テトラクロルビンホス、ホキシム、イ
ソキサチオン、ピラクロホス、メチダチオン、クロロピリホス、クロルピリホス
10 ・メチル、ピリダフェンチオン、ダイアジノン、ピリミホスメチル、ホサロン、
ホスメット、ジオキサベンゾホス、キナルホス、テルブホス、エトプロホス、カ
ズサホス、メスルフェンホス、DPS (NK-0795)、ホスホカルブ、フェ
ナミホス、イソアミドホス、ホスチアゼート、イサゾホス、エナプロホス、フェ
ンチオン、ホスチエタン、ジクロフェンチオン、チオナジン、スルプロホス、フ
15 ェンスルフォチオン、ジアミダホス、ピレトリン、アレスリン、プラレトリン、
レスメトリン、ペルメトリン、テフルトリン、ビフェントリン、フェンプロパト
リン、シペルメトリン、アルファシペルメトリン、シハロトリン、ラムダ・シハ
ロトリン、デルタメトリン、アクリナトリン、フェンバレレート、エスフェンバ
レレート、フルシトリネート、フルバリネート、シクロプロトリン、エトフェン
20 プロックス、ハルフェンプロックス、シラフルオフエン、フルシトリネート、フ
ルバリネート、メソミル、オキサミル、チオジカルブ、アルジカルブ、アラニカ
ルブ、カルタップ、メトルカルブ、キシリカルブ、プロポキスル、フェノキシカ
ルブ、フェノブカルブ、エチオフエンカルブ、フェノチオカルブ、ビフェナゼー
ト、BPMC、カルバリル、ピリミカーブ、カルボフラン、カルボスルファン、
25 フラチオカルブ、ベンフラカルブ、アルドキシカルブ、ジアフェンチウロン、ジ
フルベンズロン、テフルベンズロン、ヘキサフルムロン、ノバルロン、ルフェヌ
ロン、フルフェノクスロン、クロルフルアズロン、酸化フェンブタスズ、水酸化
トリシクロヘキシルスズ、オレイン酸ナトリウム、オレイン酸カリウム、メトプ
レン、ハイドロブレン、ビナパクリル、アミトラズ、ジコホル、ケルセン、クロ

- ルベンジレート、フェニソプロモレート、テトラジホン、ベンスルタップ、ベン
ゾメート、テブフェノジド、メトキシフェノジド、クロマフェノジド、プロパル
ギット、アセキノシル、エンドスルファン、ジオフェノラン、クロルフェナピル、
フェンピロキシメート、トルフェンピラド、フィプロニル、テブフェンピラド、
5 トリアザメート、エトキサゾール、ヘキシチアゾクス、硫酸ニコチン、ニテンピ
ラム、アセタミプリド、チアクロプリド、イミダクロプリド、チアメトキサム、
クロチアニジン、ニジノテフラン、フルアジナム、ピリプロキシフェン、ヒドラ
メチルノン、ピリミジフェン、ピリダベン、シロマジン、TPIC（トリプロピ
ルイソシアヌレート）、ピメトロジン、クロフェンテジン、ブプロフェジン、チ
10 オシクラム、フェナザキン、キノメチオネート、インドキサカルブ、ポリナクチ
ン複合体、ミルベメクチン、アバメクチン、エマメクチン・ベンゾエート、スピ
ノサッド、BT（バチルス チューリングゲンシス）、アザディラクチン、ロテノ
ン、ヒドロキシプロピルデンブン、塩酸レバミゾール、メタム・ナトリウム、酒
石酸モランテル、ダゾメット、トリクラミド、バストリア、モナクロスポリウム
15 ・フィマトパガム等の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤を例示することができ、
同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤としては、例えば硫黄、石灰硫黄合剤、塩
基性硫酸銅、イプロベンホス、エディフェンホス、トルクロホス・メチル、チラ
ム、ポリカーバメイト、ジネブ、マンゼブ、マンコゼブ、プロピネブ、チオフア
ネート、チオフアネートメチル、ベノミル、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタ
20 ジンアルベシル酸塩、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、フラメトピル、
チフルザミド、メタラキシル、オキサジキシル、カルプロバミド、ジクロフルア
ニド、フルスルファミド、クロロタロニル、クレソキシム・メチル、フェノキサ
ニル（NNF-9425）、ヒメキサゾール、エクロメゾール、フルオルイミド、
プロシミドン、ビンクロゾリン、イプロジオン、トリアジメホン、トリフルミゾ
25 ール、ビテルタノール、トリフルミゾール、イプコナゾール、フルコナゾール、
プロピコナゾール、ジフェノコナゾール、ミクロブタニル、テトラコナゾール、
ヘキサコナゾール、テブコナゾール、イミベンコナゾール、プロクロラズ、ペフ
ラゾエート、シプロコナゾール、イソプロチオラン、フェナリモル、プリメタニ
ル、メパニピリム、ピリフェノックス、フルアジナム、トリホリン、ジクロメジ

- ン、アゾキシストロビン、チアジアジン、キャプタン、プロベナゾール、アジベンゾフラール-S-メチル (CGA-245704)、フサライド、トリシクラゾール、ピロキロン、キノメチオネート、オキシリニック酸、ジチアノン、カスガマイシン、バリダマイシン、ポリオキシシ、ブラストサイジン、ストレプトマイ
- 5 シン等の農園芸用殺菌剤を例示することができ、同様に除草剤としては、例えばグリホサート、スルホセート、グルホシネート、ビアラホス、ブタミホス、エスプロカルブ、プロスルホカルブ、ベンチオカーブ、ピリブチカルブ、アシュラム、リニュロン、ダイムロン、ベンスルフロン-メチル、シクロスルファムロン、シノスルフロン、ピラゾスルフロンエチル、アジムスルフロン、イマゾスルフロン、
- 10 テニルクロール、アラクロール、プレチラクロール、クロメプロップ、エトベンザニド、メフェナセツト、ペンディメタリン、ビフェノックス、アシフルオフェン、ラクトフェン、シハロホップ-ブチル、アイオキシニル、プロモブチド、アロキシジム、セトキシジム、ナプロバミド、インダノファン、ピラゾレート、ベンゾフェナップ、ピラフルフェン・エチル、イマザピル、スルフェントラゾン、
- 15 カフェンストロール、ベントキサゾン、オキサゾアゾン、パラコート、ジクワット、ピリミノバック、シマジン、アトラジン、ジメタメトリン、トリアジフラム、ベンフレセート、フルチアセツト・メチル、キザロホップ・エチル、ベントゾン、過酸化カルシウム等の除草剤を例示することができる。

- 又、生物農薬として、例えば核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus、
- 20 NPV)、顆粒病ウイルス (Granulosis virus、GV)、細胞質多角体病ウイルス (Cytoplasmic polyhedrosis virus、CPV)、昆虫ボックスウイルス (Entomopox virus、EPV) 等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・フィマトパガム (Monacrosporium phymatophagum)、スタイナーネマ・カーポカプサエ (Steinernema carpocapsae)、スタイナーネマ・クシダエ (Steinernema
- 25 kushidai)、パスツーリア・ペネトランス (Pasteuria penetrans) 等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン (Trichoderma lignorum)、アグロバクテリウム・ラジオブクター (Agrobacterium radiobactor)、非病原性エルビニア・カロトボーラ (Erwinia carotovora)、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis) 等の殺菌剤として使用される微生物農薬、

ザントモナス・キャンペストリス (*Xanthomonas campestris*) 等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

更に、生物農薬として例えばオンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*)、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*)、ショクガタマバエ (*Aphidoletes*

- 5 aphidimyza)、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*)、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*)、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*)、ククメリスカブリダニ (*Amblyseius cucumeris*)、ナミヒメハナカメムシ (*Orius sauteri*) 等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ (*Beauveria brongniartii*) 等の微生物農薬、(Z) - 10 - テトラデセニル = アセタート、(E, Z) - 4, 10 - テ
- 10 トラデカジニエル = アセタート、(Z) - 8 - ドデセニル = アセタート、(Z) - 11 - テトラデセニル = アセタート、(Z) - 13 - イコセン - 10 - オン、(Z) - 8 - ドデセニル = アセタート、(Z) - 11 - テトラデセニル = アセタート、(Z) - 13 - イコセン - 10 - オン、14 - メチル - 1 - オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

- 15 以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例 1.

- | | |
|-------------------------|------|
| 第 1 表又は第 2 表記載の化合物 | 10 部 |
| 20 キシレン | 70 部 |
| N - メチルピロリドン | 10 部 |
| ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと | |
| アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 | 10 部 |
| 以上を均一に混合溶解して乳剤とする。 | |

25 製剤例 2.

- | | |
|--------------------|------|
| 第 1 表又は第 2 表記載の化合物 | 3 部 |
| クレー粉末 | 82 部 |
| 珪藻土粉末 | 15 部 |

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

製剤例 3.

- | | |
|--------------------|-------|
| 第 1 表又は第 2 表記載の化合物 | 5 部 |
| ベントナイトとクレーの混合粉末 | 9 0 部 |
| リグニンスルホン酸カルシウム | 5 部 |
- 5 以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

製剤例 4.

- | | |
|-----------------------|-------|
| 第 1 表又は第 2 表記載の化合物 | 2 0 部 |
| カオリンと合成高分散珪酸 | 7 5 部 |
| ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと | |
- 10 アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 5 部
- 以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

試験例 1. コナガ (*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

- ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼 2 日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第 1 表又は第 2 表記載の化合物を有効成分とする薬剤を所定の割合に希釈した薬液に約 3 0 秒間浸漬し、風乾後に 2 5 °C の恒温室に静置した。
- 15 薬液浸漬 6 日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1 区 1 0 頭 3 連制

$$\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}$$

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\quad}{\quad} \times 100$$

20

無処理区孵化虫数

判定基準. A . . . 死虫率 1 0 0 %

B . . . 死虫率 9 9 % ~ 9 0 %

C . . . 死虫率 8 9 % ~ 8 0 %

25

D . . . 死虫率 7 9 % ~ 5 0 %

E . . . 死虫率 4 9 % ~ 0 %

比較試験化合物は下記に示す特開 2 0 0 1 - 1 3 1 1 4 1 号公報に記載の化合物を使用した。

A : N² - (4 - クロロ - 2 - メチルフェニル) - 3 - ヨード - N¹ - (1 - メ

チル-2-メチルチオエチル) フタルアミド (化合物No. 9)

B : N² - (4-クロロ-2-メチルフェニル) - 3-ヨード-N¹ - (2-エチルチオ-1-メチルエチル) フタルアミド (化合物No. 24)

結果を第3表に示す。

5 試験例2. ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) に対する殺虫試験

第1表又は第2表記載の化合物を有効成分とする薬剤を所定の割合に希釈した薬液にキャベツ葉片 (品種: 四季穫) を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、ハスモンヨトウ2令幼虫を接種した後、蓋をして25℃の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記の式により

10 死虫率を算出し、判定基準は試験例1に従って行った。1区10頭3連制

無処理区生存虫数 - 処理区生存虫数

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区生存虫数} - \text{処理区生存虫数}}{\text{無処理区生存虫数}} \times 100$$

15 結果を第3表に示す。

第3表

供試化合物No.	濃度 (ppm)	試験例 1	試験例 2
2	50	A	A
	5	A	E
4	50	A	A
	5	A	E
5	50	A	A
	5	A	A
7	50	A	A
	5	A	D
19	50	A	A
	5	A	E
23	50	A	E
	5	A	E
24	50	A	C
	5	A	E
25	50	A	A
	5	A	E
26	50	A	C
	5	C	E
27	50	A	A
	5	A	E
28	50	A	A
	5	A	E
29	50	A	A
	5	A	E

第3表 (続き)

供試化合物No.	濃度 (ppm)	試験例 1	試験例 2
30	50	A	A
	5	A	E
31	50	A	A
	5	A	E
32	50	A	A
	5	A	E
42	50	A	A
	5	A	A
43	50	A	A
	5	A	E
44	50	A	A
	5	A	C
56	50	A	A
	5	A	E
57	50	A	E
	5	A	E
58	50	A	A
	5	A	E
84	50	A	A
	5	A	E
99	50	E	A
	5	A	E
100	50	A	A
	5	A	E

第3表 (続き)

供試化合物No.	濃度 (ppm)	試験例 1	試験例 2
101	50	A	-
	5	A	-
102	50	A	A
	5	A	A
103	50	A	A
	5	A	E
104	50	A	A
	5	A	E
105	50	A	A
	5	A	E
106	50	A	A
	5	A	E
107	50	A	A
	5	A	E
117	50	A	A
	5	A	A
118	50	A	A
	5	A	A
119	50	A	A
	5	A	A
123	50	A	A
	5	A	A
124	50	A	A
	5	A	E

第3表 (続き)

供試化合物No.	濃度 (ppm)	試験例 1	試験例 2
125	50	A	A
	5	A	E
142	50	A	A
	5	A	A
143	50	A	A
	5	A	E
144	50	A	D
	5	A	D
147	50	A	C
	5	A	E
148	50	A	A
	5	A	E
149	50	A	A
	5	A	E
153	50	A	A
	5	A	E
201	50	A	A
	5	A	E
202	50	A	E
	5	A	E
A	50	A	E
	5	E	E
B	50	A	E
	5	E	E

試験例 3. カンランの土壌処理によるコナガ (*Plutella xylostella*) に対する防
除効果試験

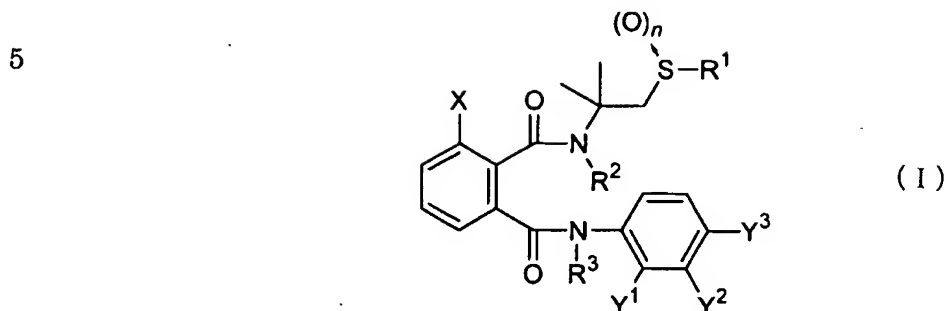
第 1 表又は第 2 表記載の化合物を製剤例に準じて作成した粒剤をカンラン (品
種: Y R 晴徳) 定植時に植え穴処理した。定植後所定日にコナガ寄生虫数を調査
5 した。結果を第 4 表に示す。第 4 表中、mg AI / 株は 1 株当たりの有効成分の
薬量 (mg) を示す。

第 4 表

供試薬剤No.	薬量 (mgAI/株)	寄生虫数 / 3 株			
		18日後	25日後	32日後	42日後
25	20	0	0	6	22
28	20	0	7	23	59
30	20	0	9	19	37
A	20	8	75	143	146
無処理	—	125	182	204	235

請求の範囲

1. 一般式 (I)



10

(式中、 R^1 、 R^2 及び R^3 は同一又は異なっても良く、水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、 C_3-C_6 アルケニル基又は C_3-C_6 アルキニル基を示し、X及び Y^3 は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子を示し、 Y^1 及び Y^2 は同一又は異なっても良く、水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_2-C_6 アルケニル基、ハロ C_2-C_6 アルケニル基、 C_2-C_6 アルキニル基、ハロ C_2-C_6 アルキニル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、ハロ C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基を示し、nは0～2の整数を示す。)

15

20

で表されるフタルアミド誘導体。

2. R^1 が C_1-C_6 アルキル基を示し、 R^2 及び R^3 が水素原子を示し、X及び Y^3 が同一又は異なっても良く、ハロゲン原子を示し、 Y^1 がハロゲン原子又は C_1-C_6 アルキル基を示し、 Y^2 がハロゲン原子を示し、nが0～2の整数を示す請求項1記載のフタルアミド誘導体。

25

3. 請求項1又は2いずれか1項記載のフタルアミド誘導体を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。

4. 請求項 3 記載の農園芸用殺虫剤の有効量を、有用植物から害虫を防除するため、対象植物又は土壌に処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の使用方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/04172

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07C323/42, 317/28, 317/40, C07D213/64, A01N37/22, 41/10, 43/40

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07C323/00, 317/00, C07D213/00, A01N37/00, 41/00, 43/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

REGISTRY (STN), CA (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 1006107 A2 (Nihon Nohyaku Co.), 07 June, 2000 (07.06.00), & JP 2001-131141 A	1-4
A	EP 919542 A2 (Nihon Nohyaku Co.), 02 June, 1999 (02.06.99), & JP 11-240857 A	1-4

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
30 July, 2002 (30.07.02)

Date of mailing of the international search report
13 August, 2002 (13.08.02)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07C323/42, 317/28, 317/40, C07D213/64
A01N37/22, 41/10, 43/40

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07C323/00, 317/00, C07D213/00
A01N37/00, 41/00, 43/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CA (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	EP 1006107 A2 (Nihon Nohyaku Co.) 2000.06.07 & JP 2001-131141 A	1-4
A	EP 919542 A2 (Nihon Nohyaku Co.) 1999.06.02 & JP 11-240857 A	1-4

☐ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

30.07.02

国際調査報告の発送日

13.08.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

前田 憲彦

印

4H

8318

電話番号 03-3581-1101 内線 3443

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ **BLACK BORDERS**
- ☐ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☒ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☐ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☐ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☐ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER:** _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.